

SPC Moxogamma 0.2/0.3/0.4 mg Filmtabletten

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. Наименование на лекарствения продукт

Мохогамма 0,2 mg Filmtabletten

Мохогамма 0,3 mg Filmtabletten

Мохогамма 0,4 mg Filmtabletten

Моксогамма 0,2 mg филмтаблетки

Моксогамма 0,3 mg филмтаблетки

Моксогамма 0,4 mg филмтаблетки

### 2. Качествен и количествен състав

Мохогамма 0,2 mg Filmtabletten

1 филмирана таблетка съдържа 0,2 mg Moxonidine

Мохогамма 0,3 mg Filmtabletten

1 филмирана таблетка съдържа 0,3 mg Moxonidine

Мохогамма 0,4 mg Filmtabletten

1 филмирана таблетка съдържа 0,4 mg Moxonidine

Помощни вещества - виж 6.1.

### 3. Лекарствена форма

филмирани таблетки

Външен вид на таблетките:

Всички таблетки са кръгли, с диаметър около 6 mm. Цветът на филмираните таблетки от 0,2 mg е светлочервен, на таблетките от 0,3 mg е червен, а на тези от 0,4 mg - тъмночервен.

### 4. Клинични данни

#### 4.1. Област на приложение

Лека до среднотежка есенциална хипертония.

#### 4.2. Дозировка, вид и продължителност на приложението

##### Възрастни

Лечението с Moxonidine трябва да се започне с най-ниска дозировка. Това означава една дневна доза от 0,2 mg Moxonidine сутрин. Ако терапевтичното действие е недостатъчно, дозата може да се увеличи до 0,4 mg, като увеличението се провежда постепенно за период от три седмици. Тази доза може да се приема като една единична доза (сутрин) или да се назначи като две единични дози за деня (сутрин и вечер). Ако резултатите от лечението през следващите три седмици все още са незадоволителни, дозировката може да се повиши до максимума от 0,6 mg, при което тя трябва да се раздели на два приема – сутрин и вечер. Единичната доза от 0,4 mg Moxonidine и дневната доза от 0,6 mg Moxonidine не трябва да се превишават.

Тъй като едновременният прием на храна не повлиява фармакокинетиката на Moxonidine, то той може да се приема преди, по време или след хранене. Таблетките трябва да се поглъщат с достатъчно количество течност.

Деца и юноши под 16 години не трябва да приемат Moxonidine, тъй като не са налични достатъчно терапевтични данни за тази възрастова група.

##### Пациенти в напреднала възраст:

В случай, че няма ограничение на бъбречната функция, важи дозировката, предоръчвана за възрастни.

##### Смушения в бъбречната функция:

При пациенти със средностепенно ограничение на бъбречната функция (гломерулна филтрация > 30 ml/минута, но < 60 ml/минута) не трябва да се превишава единичната доза от 0,2 mg и

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към

разрешение за употреба № 11-12715/3-04-2006

681/15.09.05

*Мерц*



дневната доза от 0,4 mg Мохонидине. При пациенти със силно ограничена бъбречна функция (гломерулна филтрация < 30 ml/минута) моксонидинът е противопоказан. (виж 4.3).

*Смущения на чернодробните функции:*

Не са налице с изследвания при пациенти с ограничена чернодробна функция. Тъй като моксонидинът не показва изразен чернодробен метаболизъм, не може да се очаква значимо влияние върху фармакокинетиката. При пациентите с леко до среднотежко ограничение на бъбречната функция важи препоръчителната дозировка като при възрастни. При пациентите с тежки чернодробни заболявания моксонидинът е противопоказан (виж 4.3).

Лечението не трябва да се прекъсва рязко, а да се приключи в рамките на период от две седмици, като постепенно се намалява дозировката (виж също раздел 4.4).

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към Мохонидине или към някои от помощните вещества
- Sick-Sinus-синдром или синусов блок
- Брадикардия (под 50 удара/минута в покой)
- Тежки смущения в бъбречната функция (гломерулна филтрация < 30 ml/минута, серумен креатинин > 160 µmol/l)
- ангионевротичен едем в анамнезата
- атриовентрикуларен блок II или III степен
- малигнени аритмии
- сърдечна недостатъчност (виж раздел 4.4)
- тежка коронарна болест на сърцето или нестабилна ангина пекторис
- тежки чернодробни заболявания
- 

4.4. Предупреждения и предпазни мерки при употреба

Поради липса на терапевтичен опит, Мохонидине не трябва да се прилага при:

- Claudicatio intermittens
- Болест на Raynaud
- Болест на Parkinson
- Епилептични заболявания
- Глаукома
- Депресии
- Бременност или кърмене (виж също 4.6)
- Деца и юноши под 16 години

При пациенти със средностепенно ограничение на бъбречната функция (гломерулна филтрация > 30 ml/минута, но < 60 ml/минута, серумен креатинин > 105 µmol/l, но < 160 µmol/l) антихипертензивното действие на моксонидина трябва често да се контролира, особено в началото на лечението. При тези пациенти е необходимо особено внимателно напасване на дозировката.

Макар че до сега не е наблюдавано значително повишаване на кръвното налягане (Rebound) след прекратяване приема на Мохонидине, употребата на му не трябва да се прекъсва рязко, а стъпково с понижаване на дозите в рамките на две седмици. (Вижте също раздел 4.2.)

Ако Мохонидине е комбиниран с някой бета-блокатор, и поради някаква причина трябва да се спре това антихипертензивно лечение, първо да се преустанови постепенно лечението с бета-блокатора и след няколкодневен период да се започне спирането на Мохонидине, за да се избегне повторно повишаване на артериалното налягане.

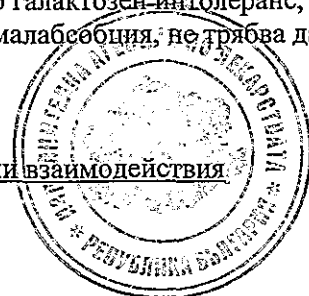
При пациенти с тежка цереброваскуларна недостатъчност, непосредствено прекаран инфаркт на миокарда и смущения в периферното кръвоснабдяване приемът на Мохонидине трябва да се провежда максимално предпазливо.

Тъй като липсват клинични данни относно безопасността при пациенти, при които едновременно е налице и среднотежка сърдечна недостатъчност, то в тези случаи моксонидинът трябва да се прилага предпазливо.

Пациенти, които страдат от редките вродени заболявания като галактозен интолеранс, частична недостатъчност на лактази, или глюкозо-галактозна малабсорбция, не трябва да приемат този лекарствен продукт.

Виж също раздели 4.2 и 4.5.

4.5. Взаимодействия с други лекарствени продукти или особени взаимодействия



Едновременната употреба на на други антихипертензивни средства засилва хипотензивното действие на Moxonidine.

Моксонидинът може да засили действието на трицикличните антидепресанти (едновременната им употреба трябва да се избягва), транквилизатори, алкохол, седативни и сънотворни средства. Седращото действие на бензодиазепините може да се засили при едновременна употреба на Moxonidine. Моксонидинът слабо понижава когнитивните функции при пациенти, които едновременно приемат лоразепам.

Моксонидинът се излъчва от организма чрез тубулна секреция. Не могат да бъдат изключени взаимодействия с други лекарствени продукти, които също се излъчват от организма чрез тубулна секреция (дигиталисови гликозиди, инсулин, сулфонилурейни продукти, нитрати, противоревматични средства, липидопонижаващи лекарствени продукти, алопуринол, колхицин, пробенецид, противоязвени средства, екстракти от щитовидна жлеза).

Толазолинът може да намали дозозависимо действието на Moxonidine.

#### 4.6. Бременност и кърмене

Не са налице достатъчно данни за приложението на Moxonidine при бременни жени. В експерименти с животни е доказана репродуктивна токсичност (виж 5.3). Не е известно какъв е потенциалният риск при хора. Моксонидинът би могло да се приема през бременността само в случай, че е безусловно необходим.

Тъй като моксонидинът преминава в майчиното мляко, не трябва да се приема по време на кърмене.

#### 4.7. Въздействие върху способността за участие в уличното движение и обслужването на машини

Не е провеждано изследване относно въздействието върху способността за шофиране и обслужване на машини. Докладвани случаи на замаяност и световъртеж. Ето защо, е необходимо повишено внимание при извършването на тези дейности.

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

Описани са сухота в устата, главоболие, усещане за слабост и световъртеж, особено чести в началото на лечението.

Честотата и интензивността на оплакванията по правило намаляват в хода на лечението.

	Много чести ( $> 1/10$ )	Чести ( $> 1/100, < 1/10$ )	Нечести ( $> 1/1000, < 1/100$ )	Много редки ( $< 1/10\ 000$ , единични случаи, по изключение)
Психични смущения		Смущения в мисловните процеси	Депресии, тревожност	
Смущения в невната система	Замаяност, главоболие, световъртеж, сънливост	Смущения в съня	Седиране	
Гастро-интестинални оплаквания		Гадене, запек и други гастроинтестинални и смущения		
Общи оплаквания	Сухота в устата	Слабост	Отоци с различна локализация, усещане за слабост в краката, ангиоедем, синкоп, задръжка на течности, загуба на апетит, болки в подушните жлези	
Функционални смущения на			Задръжка или инконтиненция на	

бъбреците и пикочните пътища			урина	
Функционални смущения в кожата и подкожните тъкани			Алергични кожни реакции	
Смущения засягащи черния дроб и жлъчката				Чернодробни реакции (хепатит, холестаза)
Очни заболявания			Усещане за сухота и сърбеж, или за парене в очите	
Функционални съдови смущения		Вазодилатация	Хипотония, ортостатична хипотония, парестезии по крайниците, синдром на Raynaud, смущения в периферното кръвообръщение	
Ендокринни смущения			Гинекомастия, импотентност или загуба на либидо	

#### 4.9. Предозиране

При следния случай на непреднамерено предозиране при 2-годишно дете е наблюдавано следното:

Не е известно какво количество моксонидин е погълнало детето. Потенциалът на приетата доза възлиза максимум на 14 mg. Детето показва следните симптоми:

Седиране, кома, хипотония, миоза и диспнея. Стомашна промивка, инфузии с глюкоза, контролирано дишане и положение на покой водят до пълно отзвучаване на симптомите в течение на 11 часа.

Въз основа на фармакологичните свойства на моксонидина могат да се очакват следните реакции при възрастни: седиране, хипотония, ортостатична дисрегулация, брадикардия, сухота в устата. В редки случаи може да се срещнат повръщане и парадоксално повишаване на кръвното налягане.

При тежки случаи на предозиране е препоръчително наблюдение преди всичко на смущенията в съзнанието и на подтискането на дишането. Лечението се състои от мерки за намаляване на резорбцията, като стомашна промивка (само ако поемането на моксонидина е станало съвсем скоро), поглъщане на активен въглен и слабители средства и други симптоматични мерки. Не е познат специфичен антидот. Редом с общите поддържащи мерки (интравенозно вливане на течности, катехоламини), фентоламинът ( $\alpha_2$ -блокатор) може дозозависимо да отслаби частично симптомите на предозирането с Мохонidine. При тежка брадикардия се препоръчва атропин.

#### 5. Фармакологични свойства

##### 5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антихипертензивни, антиадренергични средства с централно действие

АТС-код: C02AC05

При много животински модели моксонидинът е показал силно хипотензивно действие. Наличните експериментални данни сочат, че мястото на действие на Мохонidine е в централната нервна система (ЦНС).



Моксонидинът се свързва селективно с  $I_1$ -имидазолиновите рецептори в мозъчния ствол. Тези чувствителни към имидазолин рецептори се намират особено във вентролатералната Medulla oblongata - една област, която играе важна роля в централния контрол на симпатиковата нервна система. Влиянието на това взаимодействие с  $I_1$ -имидазолиновите рецептори очевидно се изразява в намаляване активността на симпатиковите нерви. Това бе доказано при симпатиковите нерви на сърцето, вътрешните органи и бъбреците.

Моксонидинът се различава от другите централнодействащи антихипертензивни средства по това, че афинитета му към централните  $\alpha_2$ -адренорецептори е оскъден в сравнение с афинитета му към  $I_1$ -имидазолиновите рецептори. Приема се, че седирането и сухотата в устата, които се срещат най-често като нежелани лекарствени реакции на антихипертензивните средства с централно действие, са резултат от въздействие върху  $\alpha_2$ -адренорецепторите.

Средното систолно и диастолно артериално налягане, както в покой, така и при упражняване на усилия са снижени.

До този момент не са налични данни относно въздействието на моксонидина върху смъртността и сърдечносъдовата заболяемост.

## 5.2. Фармакокинетични свойства

### *Абсорбция*

Моксонидинът се резорбира бързо след орално приложение. При хората се резорбират около 90 % от пероралната доза. Приемът на храна няма влияние върху фармакокинетиката на Мохонidine. Няма ефект на първо преминаване през черния дроб и биоеквивалентността възлиза на 88 %.

### *Разпределение*

Само около 7 % от моксонидина се свързват с човешките плазмени протеини ( $V_{d_{ss}} = 1,8 \pm 0,4$  l/kg). Максималните плазмени стойности/нива на моксонидин се достигат за 30-180 минути след приема на филмираната таблетка.

### *Метаболизъм*

До 10-20 % от моксонидина се метаболизира: основно до 4,5-дехидромоксонидин, както и чрез отваряне на имидазолиновия пръстен с образуване на аминометанамидинов дериват. Антихипертензивното действие на 4,5-дехидромоксонидина възлиза само на 1/10, а действието на аминометанамидиновия дериват е по-малко от 1/100 от ефекта на моксонидина.

### *Излъчване от организма*

Моксонидинът и неговите метаболити почти напълно се излъчват чрез бъбреците. Повече от 90 % от дозата се елиминира ренално през първите 24 часа, докато около 1 % се изхвърлят чрез изпражненията. Общо излъчването на моксонидин в непроменен вид възлиза на около 50-75 %. Средните стойности на плазмения елиминационен полуживот са 2,2-2,3 часа, а на реналния елиминационен полуживот - 2,6-2,8 часа.

### При пациенти със средноограничена бъбречна функция

(гломерулна филтрация 30-60 ml/минута) площта под кривата (AUC) е увеличена с 85 %, а клирънсът е намален с 52 %. При тези пациенти е необходимо напасване на дозата, като максималната дневна доза не трябва да е по-висока от 0,4 mg, а максималната единична доза - не по-висока от 0,2 mg.

### При пациенти със силно ограничени бъбречни функции (гломерулна

филтрация < 30 ml/минута) клирънсът е намален с 68% и времето на полуживот е удължено до 7 часа. При тези пациенти моксонидинът е противопоказан (виж 4.3).

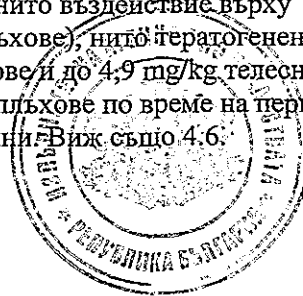
### *Фармакокинетика при деца*

Не са провеждани фармакокинетични изследвания при деца.

## 5.3. Предклинични данни за безопасност

Базирайки се върху конвенционалните изследвания за хронична токсичност, за генна токсичност, за канцерогенен потенциал и за репродуктивна токсичност, предклиничните данни не разкриват никакви особени заплахи за човека.

Изследванията върху репродуктивната токсичност не показват нито въздействие върху фертилитета (перорални дози до 6,4 mg/kg телесно тегло при плъхове), нито тератогенен потенциал (перорални дози до 27 mg/kg телесно тегло при плъхове и до 4,9 mg/kg телесно тегло при зайци). След перорални дози до 9 mg/kg телесно тегло при плъхове по време на пери- и постнаталната фаза на развитие не са установени абнормни данни. Виж също 4.6.



SPC Moxogamma 0.2/0.3/0.4 mg Filmtabletten

6. Фармацевтични данни

6.1. Помощни вещества

*Ядро на таблетката*

Lactose-Monohydrate

Crospovidone

Povidone K 25

Magnesium stearate

*Филмиращо покритие*

Hydroxypropylmethylcellulose

Titanium dioxide (E 171)

Macrogol 400

Red iron oxide (E 172).

6.2. Несъвместимости

Не са описани такива

6.3. Срок на годност

2 години

6.4. Особености на съхранение

Да се съхранява под 30°C.

6.5. Вид и съдържание на опаковките

PVC/PVDC/Al-блистери в опаковки по 30, 50 и 100 филмирани таблетки.

6.6. Указание за употреба

Няма специални указания.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Wörwag Pharma GmbH & Co. KG

Calwer Str. 7

D-71034 Böblingen

Deutschland

8. Регистрационни номера

9. Дата на регистрация

10. Актуалност на информацията

Август 2005

Статус на предписване / За разпространение чрез аптеките

По лекарско предписание

